

貯 法：室温保存  
有効期間：3年

鎮痛・抗炎症・解熱剤

日本薬局方ロキソプロフェンナトリウム錠

ロキソプロフェンNa錠60mg「アメル」

Loxoprofen Na Tablets 「AMEL」

|      |               |
|------|---------------|
| 承認番号 | 22700AMX00120 |
| 販売開始 | 1998年7月       |

## 2. 禁忌（次の患者には投与しないこと）

- 消化性潰瘍のある患者〔プロスタグランジン生合成抑制により、胃の血流量が減少し消化性潰瘍が悪化することがある。〕[9.1.2 参照]
- 重篤な血液の異常のある患者〔血小板機能障害を起し、悪化するおそれがある。〕[9.1.3 参照]
- 重篤な肝機能障害のある患者[9.3.1 参照]
- 重篤な腎機能障害のある患者[9.2.1 参照]
- 重篤な心機能不全のある患者[9.1.4 参照]
- 本剤の成分に対し過敏症の既往歴のある患者
- アスピリン喘息（非ステロイド性消炎鎮痛剤等による喘息発作の誘発）又はその既往歴のある患者〔アスピリン喘息発作を誘発することがある。〕[9.1.5 参照]
- 妊娠後期の女性[9.5.1 参照]

## 3. 組成・性状

### 3.1 組成

|      |  |
|------|--|
| 販売名  | ロキソプロフェン Na 錠 60mg 「アメル」                               |
| 有効成分 | 1 錠中、日局ロキソプロフェンナトリウム水和物 68.1mg（無水物として 60mg）を含有する。      |
| 添加剤  | 乳糖水和物、トウモロコシデンプン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、ステアリン酸マグネシウム、三二酸化鉄 |

### 3.2 製剤の性状

| 販売名                     | 剤形・色     | におい・味         | 外形・大きさ等   | 識別コード  |
|-------------------------|----------|---------------|---|--------|
| ロキソプロフェン Na 錠 60mg「アメル」 | 片面割線入り素錠 | においはない        |  | KW 828 |
|                         | うすい紅色    | わずかに特異な取れん性の味 | 直径：約 9.0mm<br>厚さ：約 3.9mm<br>質量：約 300mg  |        |

## 4. 効能又は効果

- 下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛  
関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、歯痛
- 手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消炎
- 下記疾患の解熱・鎮痛  
急性上気道炎（急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む）

## 6. 用法及び用量

| 効能又は効果  | 用法及び用量   |
|---|--|
| 下記疾患並びに症状の消炎・鎮痛<br>関節リウマチ、変形性関節症、腰痛症、肩関節周囲炎、頸肩腕症候群、歯痛 | 通常、成人にロキソプロフェンナトリウム（無水物として）1回 60mg、1日3回経口投与する。頓用の場合は、1回 60～120mg を経口投与する。<br>なお、年齢、症状により適宜増減する。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。     |
| 手術後、外傷後並びに抜歯後の鎮痛・消炎                                   | 通常、成人にロキソプロフェンナトリウム（無水物として）1回 60mg を頓用する。<br>なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、原則として1日2回までとし、1日最大 180mg を限度とする。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。 |
| 下記疾患の解熱・鎮痛<br>急性上気道炎（急性気管支炎を伴う急性上気道炎を含む）              | 通常、成人にロキソプロフェンナトリウム（無水物として）1回 60mg を頓用する。<br>なお、年齢、症状により適宜増減する。ただし、原則として1日2回までとし、1日最大 180mg を限度とする。また、空腹時の投与は避けさせることが望ましい。 |

## 7. 用法及び用量に関連する注意

- 他の消炎鎮痛剤との併用は避けることが望ましい。

## 8. 重要な基本的注意

- 消炎鎮痛剤による治療は原因療法ではなく対症療法であることに留意すること。
- 過度の体温下降、虚脱、四肢冷却等があらわれることがあるので、特に高熱を伴う高齢者又は消耗性疾患を合併している患者においては、投与後の患者の状態に十分注意すること。
- 無顆粒球症、白血球減少、溶血性貧血、再生不良性貧血、血小板減少があらわれることがあるので、血液検査を行うなど観察を十分に行うこと。[11.1.2 参照]
- 急性疾患に対し本剤を使用する場合には、次の事項を考慮すること。
  - 急性炎症、疼痛及び発熱の程度を考慮し、投与すること。
  - 原則として同一の薬剤の長期投与を避けること。
  - 原因療法があればこれを行い、本剤を漫然と投与しないこと。
- 慢性疾患（関節リウマチ、変形性関節症等）に対し本剤を用いる場合には、次の事項を考慮すること。
  - 長期投与する場合には定期的に尿検査、血液検査及び肝機能検査等を行うこと。
  - 薬物療法以外の療法も考慮すること。

## 9. 特定の背景を有する患者に関する注意

- 合併症・既往歴等のある患者
  - 消化性潰瘍の既往歴のある患者  
潰瘍を再発させることがある。
  - 非ステロイド性消炎鎮痛剤の長期投与による消化性潰瘍のある患者で、本剤の長期投与が必要であり、かつミソプロストールによる治療が行われている患者  
本剤を継続投与する場合には、十分経過を観察し、慎重に投与すること。ミソプロストールは非ステロイド性消炎鎮痛剤により生じた消化性潰瘍を効能・効果としているが、ミソプロストールによる治療に抵抗性を示す消化性潰瘍もある。[2.1 参照]

- 9.1.3 血液の異常又はその既往歴のある患者（重篤な血液の異常のある患者を除く）  
溶血性貧血等の副作用が起りやすくなる。[2.2 参照]
- 9.1.4 心機能異常のある患者（重篤な心機能不全のある患者を除く）  
腎のプロスタグランジン合成抑制により浮腫、循環体液量の増加が起り、心臓の仕事量が増加するため症状を悪化させるおそれがある。[2.5 参照]
- 9.1.5 気管支喘息の患者（アスピリン喘息又はその既往歴のある患者を除く）  
病態を悪化させることがある。[2.7 参照]
- 9.1.6 潰瘍性大腸炎の患者  
病態を悪化させることがある。
- 9.1.7 クロウン病の患者  
病態を悪化させることがある。
- 9.1.8 感染症を合併している患者  
必要に応じて適切な抗菌剤を併用し、観察を十分に行い慎重に投与すること。感染症を不顕性化するおそれがある。
- 9.2 腎機能障害患者
- 9.2.1 重篤な腎機能障害のある患者  
投与しないこと。急性腎障害、ネフローゼ症候群等の副作用を発現することがある。[2.4 参照]
- 9.2.2 腎機能障害又はその既往歴のある患者（重篤な腎機能障害のある患者を除く）  
浮腫、蛋白尿、血清クレアチニン上昇、高カリウム血症等の副作用が起ることがある。
- 9.3 肝機能障害患者
- 9.3.1 重篤な肝機能障害のある患者  
投与しないこと。副作用として肝機能障害が報告されており、悪化するおそれがある。[2.3 参照]
- 9.3.2 肝機能障害又はその既往歴のある患者（重篤な肝機能障害のある患者を除く）  
肝機能障害を悪化又は再発させることがある。
- 9.5 妊婦
- 9.5.1 妊娠後期の女性  
投与しないこと。動物実験（ラット）で分娩遅延及び胎児の動脈管収縮が報告されている。[2.8 参照]
- 9.5.2 妊婦（妊娠後期を除く）又は妊娠している可能性のある女性  
治療上の有益性が危険性を上回ると判断される場合にのみ投与すること。投与する際には、必要最小限にとどめ、適宜羊水量を確認するなど慎重に投与すること。シクロオキシゲナーゼ阻害剤（経口剤、坐剤）を妊婦に使用し、胎児の腎機能障害及び尿量減少、それに伴う羊水過少症が起きたとの報告がある。
- 9.6 授乳婦  
治療上の有益性及び母乳栄養の有益性を考慮し、授乳の継続又は中止を検討すること。動物実験（ラット）で乳汁中への移行が報告されている。
- 9.7 小児等  
小児等を対象とした臨床試験は実施していない。
- 9.8 高齢者  
少量から投与を開始するなど必要最小限の使用にとどめ患者の状態を観察しながら慎重に投与すること。副作用があらわれやすい。

## 10. 相互作用

### 10.2 併用注意（併用に注意すること）

| 薬剤名等                        | 臨床症状・措置方法                           | 機序・危険因子   |
|-----------------------------|-------------------------------------|---|
| クマリン系抗凝血剤<br>ワルファリン         | 抗凝血作用を増強するおそれがあるので注意し、必要があれば減量すること。 | 本剤のプロスタグランジン合成抑制作用により血小板凝集が抑制され血液凝固能が低下し、抗凝血作用に相加されるためと考えられている。 |
| 第Xa因子阻害剤<br>エドキサバントシル酸塩水和物等 | 出血の危険性を増大させるおそれがある。                 | 抗血栓作用を増強するためと考えられている。   |

| 薬剤名等                               | 臨床症状・措置方法  | 機序・危険因子  |
|------------------------------------|--|--|
| スルホニル尿素系<br>血糖降下剤<br>クロルプロパミド等     | 血糖降下作用を増強するおそれがあるので注意し、必要があれば減量すること。                       | 本剤のヒトでの蛋白結合率は、ロキソプロフェンで97.0%、trans-OH体で92.8%と高く、蛋白結合率の高い薬剤と併用すると血中に活性型の併用薬が増加し、作用が増強されるためと考えられている。 |
| ニューキノロン系<br>抗菌剤<br>レボフロキサシン水和物等    | 痙攣誘発作用を増強することがある。  | ニューキノロン系抗菌剤は、中枢神経系の抑制性神経伝達物質であるGABAの受容体への結合を阻害し、痙攣誘発作用を起こす。本剤の併用により阻害作用を増強するためと考えられている。            |
| メトトレキサート                           | 血中メトトレキサート濃度を上昇させ、作用を増強することがあるので、必要があれば減量すること。             | 機序は不明であるが、本剤の腎におけるプロスタグランジン合成抑制作用により、これらの薬剤の腎排泄が減少し血中濃度が上昇するためと考えられている。                            |
| リチウム製剤<br>炭酸リチウム                   | 血中リチウム濃度を上昇させ、リチウム中毒を起こすことがあるので血中のリチウム濃度に注意し、必要があれば減量すること。 | 機序は不明であるが、本剤の腎におけるプロスタグランジン合成抑制作用により、これらの薬剤の腎排泄が減少し血中濃度が上昇するためと考えられている。                            |
| チアジド系利尿薬<br>ヒドロクロロチアジド等            | 利尿・降圧作用を減弱するおそれがある。  | 本剤の腎におけるプロスタグランジン合成抑制作用により、水、ナトリウムの排泄を減少させるためと考えられている。   |
| 降圧剤<br>ACE阻害剤<br>アンジオテンシンII受容体拮抗剤等 | 降圧作用を減弱するおそれがある。   | 本剤のプロスタグランジンの生合成抑制作用により、降圧作用を減弱させる可能性がある。  |
| 降圧剤<br>ACE阻害剤<br>アンジオテンシンII受容体拮抗剤等 | 腎機能を悪化させるおそれがある。   | 本剤のプロスタグランジンの生合成抑制作用により、腎血流量が低下するためと考えられる。   |

## 11. 副作用

次の副作用があらわれることがあるので、観察を十分に行い、異常が認められた場合には投与を中止するなど適切な処置を行うこと。

### 11.1 重大な副作用

11.1.1 ショック（頻度不明）、アナフィラキシー（頻度不明）  
ショック、アナフィラキシー（血圧低下、蕁麻疹、喉頭浮腫、呼吸困難等）があらわれることがある。

- 11.1.2 無顆粒球症（頻度不明）、白血球減少（頻度不明）、溶血性貧血（頻度不明）、再生不良性貧血（頻度不明）、血小板減少（頻度不明）  
[8.3 参照]
- 11.1.3 中毒性表皮壊死融解症（Toxic Epidermal Necrolysis：TEN）（頻度不明）、皮膚粘膜眼症候群（Stevens-Johnson 症候群）（頻度不明）、多形紅斑（頻度不明）、急性汎発性発疹性膿疱症（頻度不明）
- 11.1.4 急性腎障害（頻度不明）、ネフローゼ症候群（頻度不明）、間質性腎炎（頻度不明）  
急性腎障害に伴い高カリウム血症があらわれることがあるので、特に注意すること。
- 11.1.5 うっ血性心不全（頻度不明）
- 11.1.6 間質性肺炎（頻度不明）  
発熱、咳嗽、呼吸困難、胸部 X 線異常、好酸球増多等を伴う間質性肺炎があらわれることがあるので、このような症状があらわれた場合には直ちに投与を中止し、副腎皮質ホルモン剤の投与等の適切な処置を行うこと。
- 11.1.7 消化性潰瘍（頻度不明）、消化管出血（頻度不明）  
重篤な消化性潰瘍又は小腸、大腸からの吐血、下血、血便等の消化管出血が出現し、それに伴うショックがあらわれることがあるので、これらの症状が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 11.1.8 消化管穿孔（頻度不明）  
心窩部痛、腹痛等の症状が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 11.1.9 小腸・大腸の狭窄・閉塞（頻度不明）  
小腸・大腸の潰瘍に伴い、狭窄・閉塞があらわれることがあるので、悪心・嘔吐、腹痛、腹部膨満等の症状が認められた場合には直ちに投与を中止し、適切な処置を行うこと。
- 11.1.10 劇症肝炎（頻度不明）、肝機能障害（頻度不明）、黄疸（頻度不明）  
肝機能障害（黄疸、AST 上昇、ALT 上昇、 $\gamma$ -GTP 上昇等）、劇症肝炎があらわれることがある。
- 11.1.11 喘息発作（頻度不明）  
喘息発作等の急性呼吸障害があらわれることがある。
- 11.1.12 無菌性髄膜炎（頻度不明）  
無菌性髄膜炎（発熱、頭痛、悪心・嘔吐、項部硬直、意識混濁等）があらわれることがある。特に SLE や混合性結合組織病の患者に発現しやすい。
- 11.1.13 横紋筋融解症（頻度不明）  
筋肉痛、脱力感、CK 上昇、血中及び尿中ミオグロビン上昇等が認められた場合には、投与を中止し、適切な処置を行うこと。また、横紋筋融解症による急性腎障害の発症に注意すること。

## 11.2 その他の副作用

|                   | 0.1～2%未満                               | 0.1%未満     | 頻度不明  |
|-------------------|--|------------|---|
| 過敏症 <sup>注)</sup> | 発疹、そう痒感                                |            | 発熱、蕁麻疹  |
| 消化器               | 腹痛、胃部不快感、食欲不振、悪心、下痢、便秘、胸やけ、口内炎、腹部膨満、口渇 | 嘔吐         | 消化性潰瘍 <sup>注)</sup> 、小腸・大腸の潰瘍 <sup>注)</sup> 、消化不良 |
| 循環器               |  | 動悸、血圧上昇    |   |
| 精神神経系             | 眠気                                     | 頭痛、めまい、しびれ |   |
| 血液                |  | 好酸球増多      | 貧血、白血球減少、血小板減少                                    |
| 肝臓                | AST 上昇、ALT 上昇                          | ALP 上昇     |   |
| 泌尿器               | 蛋白尿                                    |            | 血尿、排尿困難、尿量減少                                      |
| その他               | 浮腫、顔面熱感                                |            | 胸痛、倦怠感、発汗   |

注) 投与を中止すること。

## 14. 適用上の注意

### 14.1 薬剤交付時の注意

PTP 包装の薬剤は PTP シートから取り出して服用するよう指導すること。PTP シートの誤飲により、硬い鋭角部が食道粘膜へ刺入し、更には穿孔をおこして縦隔洞炎等の重篤な合併症を併発することがある。

## 15. その他の注意

### 15.1 臨床使用に基づく情報

非ステロイド性消炎鎮痛剤を長期間投与されている女性において、一時的な不妊が認められたとの報告がある。

## 16. 薬物動態

### 16.1 血中濃度

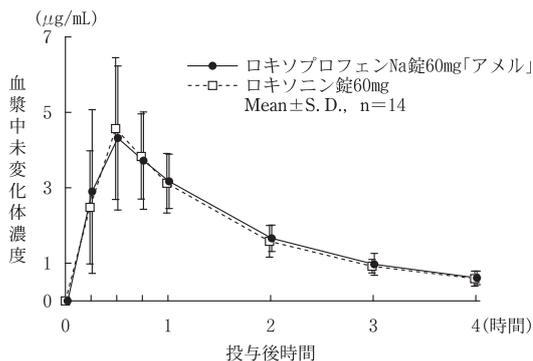
#### 16.1.1 生物学的同等性試験

ロキソプロフェン Na 錠 60mg「アメル」とロキソニン錠 60mg を、クロスオーバー法によりそれぞれ 1 錠（ロキソプロフェンナトリウム水和物を無水物として 60mg）健康成人男子に絶食単回経口投与して血漿中未変化体濃度を測定し、得られた薬物動態パラメータ（AUC、Cmax）について統計解析を行った結果、両剤の生物学的同等性が確認された<sup>1)</sup>。

薬物動態パラメータ（生物学的同等性）

|                         | AUC <sub>(0-4)</sub><br>( $\mu\text{g} \cdot \text{hr}/\text{mL}$ ) | Cmax<br>( $\mu\text{g}/\text{mL}$ ) | Tmax<br>(hr) | T <sub>1/2</sub><br>(hr) |
|-------------------------|---|-------------------------------------|--------------|--------------------------|
| ロキソプロフェン Na 錠 60mg「アメル」 | 7.65 ± 1.62   | 5.11 ± 1.14                         | 0.57 ± 0.21  | 1.39 ± 0.27              |
| ロキソニン錠 60mg             | 7.46 ± 1.62   | 4.91 ± 1.30                         | 0.61 ± 0.16  | 1.45 ± 0.31              |

(Mean ± S.D., n = 14)



血漿中未変化体濃度（生物学的同等性）

血漿中濃度並びに AUC、Cmax 等のパラメータは、被験者の選択、体液の採取回数・時間等の試験条件によって異なる可能性がある。

## 18. 薬効薬理

### 18.1 作用機序

ロキソプロフェンナトリウム水和物は経口投与されたとき、胃粘膜刺激作用の弱い未変化体のまま消化管より吸収され、その後速やかにプロスタグランジン合成抑制作用の強い活性代謝物 trans-OH 体（SRS 配位）に変換されて作用する。シクロオキシゲナーゼを作用点としたプロスタグランジン合成抑制作用により、すぐれた鎮痛・抗炎症・解熱作用を有し、特に鎮痛作用が強力である<sup>2),3)</sup>。

## 19. 有効成分に関する理化学的見聞

### 一般名

ロキソプロフェンナトリウム水和物（Loxoprofen Sodium Hydrate）

### 化学名

Monosodium 2-[4-[(2-oxocyclopentyl)methyl]phenyl]propanoate dihydrate

### 分子式

C<sub>15</sub>H<sub>17</sub>NaO<sub>3</sub> · 2H<sub>2</sub>O

### 分子量

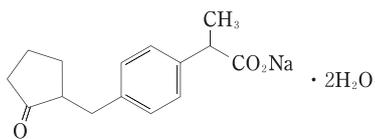
304.31

### 性状

白色～帯黄白色の結晶又は結晶性の粉末である。水又はメタノールに極めて溶けやすく、エタノール（95）に

溶けやすく、ジエチルエーテルにほとんど溶けない。  
本品の水溶液（1→20）は旋光性を示さない。  
本品 1.0g を新たに煮沸して冷却した水 20mL に溶かした液  
の pH は 6.5～8.5 である。

#### 構造式



#### 22. 包装

100錠 [10錠 (PTP) ×10]  
1,000錠 [10錠 (PTP) ×100]

#### 23. 主要文献

- 1) 社内資料：生物学的同等性試験 [錠 60mg]
- 2) 松田啓一, 他：炎症. 1982；2 (3)：263-266
- 3) 山口武, 他：炎症. 1983；3 (1)：63-67

#### 24. 文献請求先及び問い合わせ先

共和薬品工業株式会社 お問い合わせ窓口  
〒530-0005 大阪市北区中之島3-2-4  
☎ 0120-041-189  
FAX 06-6121-2858

#### 26. 製造販売業者等

##### 26.1 製造販売元

**共和薬品工業株式会社**

大阪市北区中之島3-2-4